In the name of Allah, the Most Gracious, the Most Merciful













Pénicilline et céphalosporines

PENICILLINES

- 1- STRUCTURES ET CARACTERISTIQUES

- Noyau beta lactam
- Noyau thiazolidine



Présentation de la pénicilline

Présentation de la pénicilline
poudre sèche à 4°C
conservation de la sol. Pdt 24h à 20°C. utiliser dès la mise en solution.



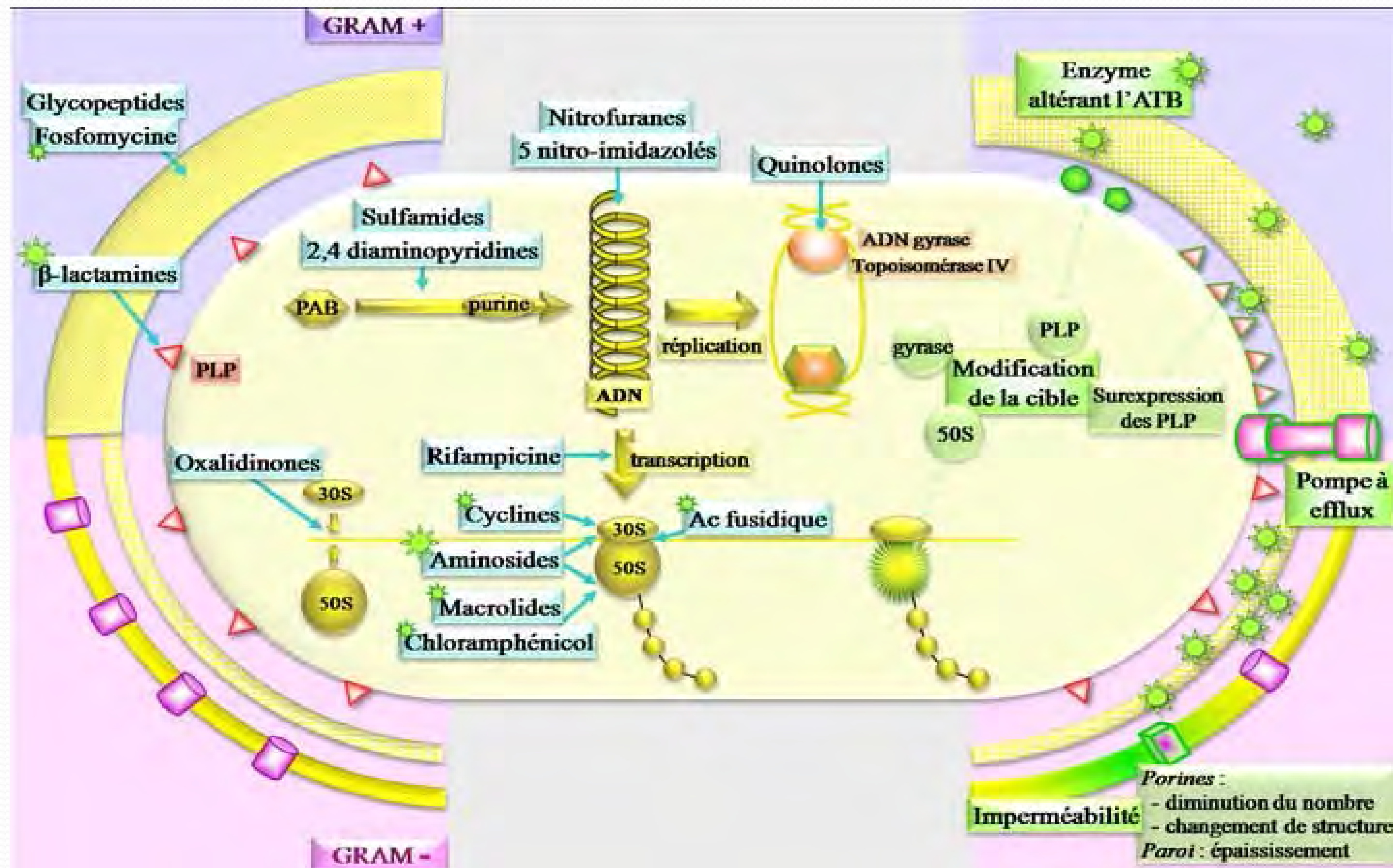


Activité antibactérienne

- 1- liaison de la molécule de péni aux **PBP (pénicilline binding proteine).**
- 2- **Inhibition de la synthèse de la paroi bactérienne**.
- 3- **Activation des enzymes autolytiques** de la paroi bactérienne conduisant à la lyse bactérienne.

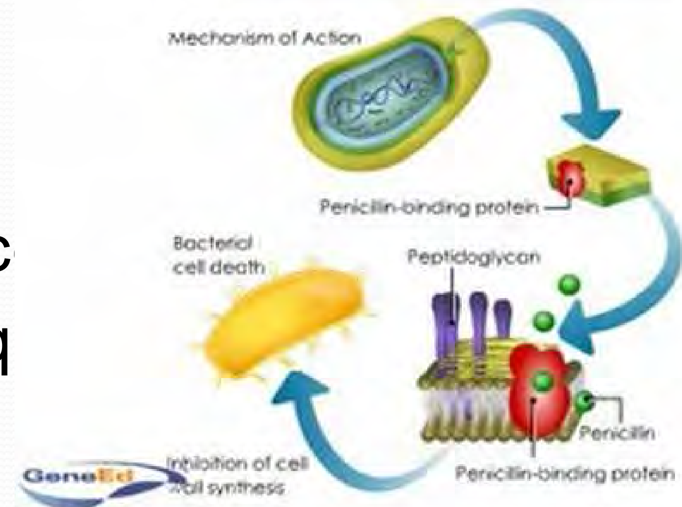
- Pénicillines et céphalosporines: bactéricides chez les bactéries qui synthétisent les peptidoglycans.

Activité antibactérienne



Résistance bactérienne

- 1- Béta lactamases (sous contrôle génétique, par l'intermédiaire de plasmide transmissible)
- Absence de pérméabilité d
  Couches superficielles.
- Absence de paroi
- Absence de PBP, ou inacc
- Inactivation des enz lytiq



pharmacocinétique

- Absorption : Voie IV: rapide, complète.
- Voie IM : bonne absorption, parfois douleur au point d'injection.
- Voie orale: différence d'absorption d'une péni à une autre.
- Due à la stabilité en milieu acide gastrique.
- Admin. À distance des repas.

- Concentration pl. de la péni = concentration tissulaire
- Concentration inf dans le SNC

- Bon passage de la péni en cas de méningite (inflamm des méninges) par 3 mécanismes:
- 1- Perméabilité des méninges lors de méningites (imperméables sans méningites)
- 2- Inhibition des transports actifs (reposse la péni en dehors du LCR.
- 3- Liaison de la péni aux protéines du LCR

- Les péni atteignent aussi les épanchements pleuraux, péricardiques ou articulaires

- Excretion:
- - Urinaire.
- - T1/2 Plasmarique: ½ h à 1 heure
- 10 h en cas d'insuffisance rénale.
- Excrétion par le lait maternel 3- 15 %

- Nafcilline: excrétée à 80 % par voie biliaire; 20 % par voie rénale

Pénicilline sensibles à la pénicillinase

- **Benzyl pénicilline (pénicilline G):** en injectable.
- Utilisée dans les infections sévères
- - Méningite et endocardite à germe sensible
- - Gangrène gazeuse à clostridium.
- - Infection cutanées à streptocoque
- - Otite moyenne aigue
- Précaution: ANTC d'allergie; IR; Icard; réaction type Herxheimer.



- Effets indésirables: urticaires; état féb

douleurs articulaires; choc anaph.

(rare 0,05 %)



Effets indésirables

- Allergie
- Troubles digestifs
- Leucopénies
- Augmentation transitoire des transaminases
- Augmentation de la créatinémie
- Encéphalopathies
- Troubles du rythme cardiaque

La benzathine benzylpénicilline (extencilline*)

- C'est un mélange de benzylpénicilline (pénicilline G) et de benzatine.
- Agissent sur le T*reponoma pallidum*, la bactérie de la syphilis.
- Cette forme de pénicilline à libération lente se donne en une seule injection intramusculaire ; la dose diffuse ensuite lentement dans l'organisme pendant 3 à 4 semaines, à la fin de laquelle une syphilis primaire sera normalement guérie.
- Pharyngites streptococciques
- Prophylaxie de rechute de RAA

Procaine penicilline

- Effet prolongé 4- 5 jours.
- - endocardite streptococcique.
- - syphilis et gonorrhée, chez les patients dont la compliance est douteuse.
- EI neuro dus à la procaine: vertiges, troubles auditifs, convulsion etc.)
- Ne pas utiliser la voie IV ni chez l'enfant de moins de 5 ans.

Phénoxyméthylpénicilline (Péni V)

- Résorption à 60 %, administrer 30 à 60 mn avant les repas.
- Indiqué dans des infections bénignes des voies respiratoires hautes.

Pénicilline résistantes aux pénicillinases ou péni M

- Ces pénicillines sont la méticilline, oxacilline, cloxacilline .
- Elles ont toutes le même spectre d'action, soit celui des pénicillines conventionnelles plus les bactéries protégées par des pénicillinases, comme la majorité des souches de *Staphylococcus aureus*. Elles n'ont cependant aucune action contre le Staphylocoque aureus résistant à la méticilline (SARM).
- La méticilline, prototype de la famille, ne sert plus guère qu'à effectuer des tests de sensibilité.
- La cloxacilline intraveineuse a malheureusement le défaut d'être très irritante pour les veines, entraînant souvent des phlébite au site d'injection ; de plus, sa demi- vie courte oblige à l'administrer toutes les 4 heures.

Aminopénicillines

- Actifs sur : les entérocoques; H.Influenzea; E coli; Proteus.
- Amoxicilline et ampicilline: IV, IM et orale.
- Voie orale pour traiter:
- - Otite moyenne
- - Sinusite
- - Infections urinaires
- - Gastro entérite à salmonella
- - Infections des tissus mous
- - Gonorrhées

Combinaisons d'un inhibiteur des béta lactamases avec des pénicillines

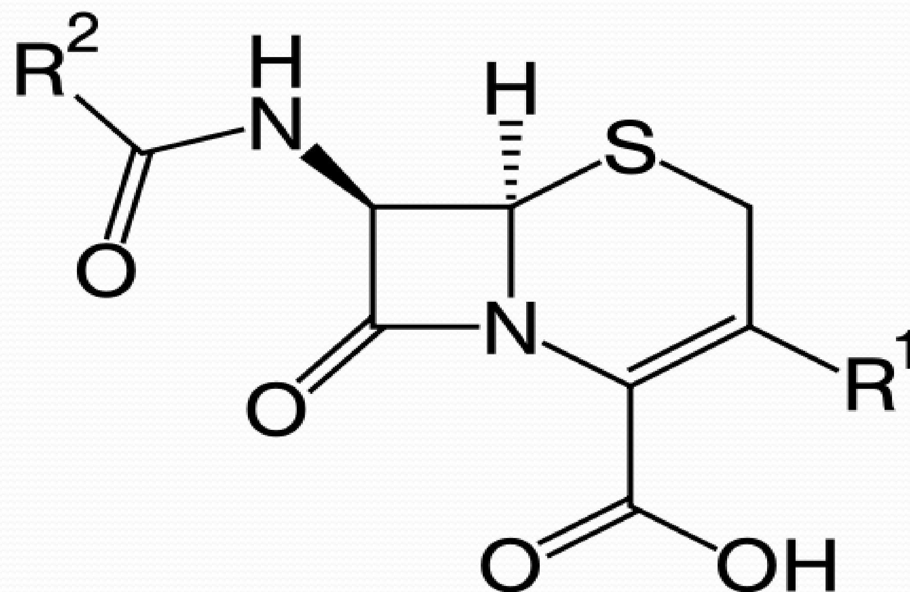
- Amoxicilline- acide clavulanique (augmentin*).
- Ticarcilline- acide clavulanique (claventin*)

- - Infection urinaire
- - Otite
- - Sinusite
- - Certaines affections des tissus mous et des os.
- L'association ne doit etre utilisé que si les bactéries résistent à l'*amoxicilline* ou à la

Effets indésirables

- Hépatite aigue
- Allergie.
- Neutropénie

céphalosporines



- Mécanisme d'action et de résistance comme pour les pénicillines.

céphalosporine	**1ère génération**	**2ème génération**	**3ème génération**
Activité antibacterienne	G+; G- E coli; Klebsiella pneumonie Moins actif sur pseudomonas aeroginosa (pyocyanique)	Moins actif sur G + Actif sur G - (enterobactérie)	Actif sur G – Traverse la barrière hémato encéphalique
Voie orale IV Usage thérapeutique	Absorption intestinale [C]tissulaire<[C]plasmatique Élimination rénale Ne passe pas dans le LCR	TRT des diverticulites et péritonites	Pénétration dans le LCR et bonne activité Bonne activité sur beaucoup de germe et meme le pseudomonas
	Céfalexine Céfazoline céfalotine	Céfoxitime Céfaclor Céfamandole céfonicide	Céfotaxime Ceftriaxone Céfopérazone Céfotétan moxalactam

- MERCI